

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2001-199882

(P2001-199882A)

(43) 公開日 平成13年7月24日 (2001.7.24)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 K 31/192		A 6 1 K 31/192	4 C 0 8 6
31/4402		31/4402	4 C 2 0 6
31/4535		31/4535	
31/5415		31/5415	
A 6 1 P 27/16		A 6 1 P 27/16	

審査請求 未請求 請求項の数7 O L (全 5 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2000-11198(P2000-11198)

(22) 出願日 平成12年1月20日(2000.1.20)

(71) 出願人 000002819

大正製薬株式会社

東京都豊島区高田3丁目24番1号

(72) 発明者 武永 敬明

東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製
薬株式会社内

(72) 発明者 奥平 一郎

東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製
薬株式会社内

(74) 代理人 100074114

弁理士 北川 富造

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 感冒・鼻炎用組成物

(57) 【要約】

【課題】 風邪等による鼻炎症状のうち鼻閉に対する効果が高い感冒・鼻炎用組成物を提供する。

【解決手段】 下記(a)および(b)を配合してなる感冒・鼻炎用組成物。

(a) ロキソプロフェン類 (b) 抗アレルギー薬および抗ヒスタミン薬からなる群から選ばれる少なくとも1種

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記(a)および(b)を配合してなる感冒・鼻炎用組成物。

(a) ロキソプロフェン類

(b) 抗アレルギー薬および抗ヒスタミン薬からなる群から選ばれる少なくとも1種

【請求項2】 抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬が、カルビノキサミン、クロルフェニラミン、ケトチフェン、メキタジン、エピナスチンまたはこれらの塩類から選ばれる少なくとも1種である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【請求項3】 (b)成分がカルビノキサミンまたはその塩類であり、(a)成分1重量部に対する(b)成分の配合量が0.01~0.1重量部である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【請求項4】 (b)成分がクロルフェニラミンまたはその塩類であり、(a)成分1重量部に対する(b)成分の配合量が0.005~0.1重量部である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【請求項5】 (b)成分がケトチフェンまたはその塩類であり、(a)成分1重量部に対する(b)成分の配合量が0.005~0.05重量部である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【請求項6】 (b)成分がメキタジンまたはその塩類であり、(a)成分1重量部に対する(b)成分の配合量が0.01~0.1重量部である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【請求項7】 (b)成分がエピナスチンまたはその塩類であり、(a)成分1重量部に対する(b)成分の配合量が0.05~0.5重量部である請求項1記載の感冒・鼻炎用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、風邪による症状のうち鼻閉(鼻づまり)に対する効果が増強された感冒・鼻炎用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】風邪症候群はウイルス性の呼吸器感染症であり、一般に、上気道を中心とする局所炎症性症状に倦怠感等の種々の全身症状を伴う疾患である。

【0003】風邪症候群の原因療法として抗ウイルス作用を有する薬剤が望まれているが、未だ有効なものが開発されておらず、風邪症候群の改善には対症療法が中心となっている。対症療法の中心は解熱鎮痛薬成分による発熱時の解熱、疼痛症状発症時の鎮痛などであり、これらの症状の改善のためにロキソプロフェンなどの薬剤が使用されてきた。

【0004】しかし、日常生活を営む上で、風邪による各種の症状のうち鼻炎症状、特に鼻閉(鼻づまり)症状は呼吸不全を来すことから、口呼吸で補填しなくてはな

らず、外気が直接肺へ取り込むことにより新たなウイルスや細菌の感染に結びつき、症状の遷延化を招く不都合が生じていた。

【0005】したがって、風邪の早期に鼻閉(鼻づまり)症状を改善することにより、症状の軽快または治癒の促進が期待できる。

【0006】従来、鼻粘膜の炎症症状改善には抗ヒスタミン薬が主に使われており、これに加えて鼻汁分泌抑制薬、鼻閉除去を目的とした交感神経興奮薬等を配合したものが中心となっているが、何れも風邪等に伴う鼻粘膜の炎症症状に対する効果は不十分であった。

【0007】

【発明が解決しようとする課題】本発明は風邪の諸症状のうち、特に鼻粘膜の炎症症状(鼻閉など)の除去あるいは軽減に特化した感冒・鼻炎用組成物を提供することを目的とする。

【0008】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、目的を達成するために種々検討した結果、有効成分としてロキソプロフェンおよび抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬を同時に配合することにより、鼻粘膜の炎症症状(鼻閉など)の除去あるいは軽減に対し劇的な効果が発現することを見出し、本発明を完成した。

【0009】すなわち本発明は、(a)ロキソプロフェン類、(b)抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬を配合してなる感冒および鼻炎用組成物である。

【0010】

【発明の実施の形態】本発明でロキソプロフェン類とは、ロキソプロフェンおよびその薬学的に許容される塩であり、それらを混合して用いることもできる。ロキソプロフェン類の配合量は、成人に対する1日投与量で90~180mgが好ましい。

【0011】本発明で抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬としては、カルビノキサミン、クロルフェニラミン、ケトチフェン、メキタジン、エピナスチン並びにこれらの塩類などが好ましい。ここで塩類とは、塩酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、臭化水素酸塩、カリウム塩、ナトリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩などがあげられる。

【0012】抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬の配合量は、カルビノキサミンまたはその塩類の場合1日投与量で5~10mg、クロルフェニラミンまたはその塩類の場合2~10mg、メキタジンまたはその塩類の場合2~12mg、ケトチフェンまたはその塩類の場合0.5~3mg、エピナスチンまたはその塩類の場合2~25mgが好ましい。

【0013】ロキソプロフェン類1質量部に対する抗アレルギー薬または抗ヒスタミン薬の配合量は、カルビノキサミンまたはその塩類の場合0.01~0.1重量

部、クロルフェニラミンまたはその塩類の場合0.005~0.1重量部、ケトチフェンまたはその塩類の場合0.005~0.05重量部、メキタジンまたはその塩類の場合0.01~0.1重量部、エピナスチンまたはその塩類の場合0.05~0.5重量部がそれぞれ好ましい。

【0014】本発明の感冒・鼻炎用組成物は、通常、成人に対して1日当たり1回ないし数回に分けて経口投与することができ、投与量は年齢、体重、病状により適宜増減することができる。

【0015】本発明の感冒・鼻炎用組成物は、剤型として錠剤、カプセル剤、顆粒剤、細粒剤、チュアブル剤、発泡剤、ドロップ剤、口中溶解剤、ドライシロップ剤、内服液剤等の経口投与形態の製剤とすることができ、常法により製造することができる。

【0016】本発明の感冒・鼻炎用組成物を製造すると

の錠剤を得た。

ロキソプロフェンナトリウム	90g
ノスカピン	48g
リン酸ジヒドロコデイン	24g
フマル酸ケトチフェン	4g
塩酸アンブロキシソール	45g
フェニルプロパノールアミン	60g
テオフィリン	150g
塩化リゾチーム	90g (力価)
無水カフェイン	75g
ビタミンB ₁ 硝酸塩	8g
ビタミンB ₂	4g
乳糖	350g
微結晶セルロース	320g
ステアリン酸マグネシウム	16g
硬化ヒマシ油	16g

【0019】実施例2

下記の各成分および分量を秤量し均一に混合した後、常

ロキソプロフェンナトリウム	180g
ノスカピン	48g
リン酸ジヒドロコデイン	24g
メキタジン	6g
塩酸プロムヘキシシ	12g
塩化リゾチーム	90g (力価)
乳糖	710g
微結晶セルロース	710g
ステアリン酸マグネシウム	10g
硬化ヒマシ油	10g

【0020】実施例3

下記の各成分および分量を秤量し均一に混合した後、得

ロキソプロフェンナトリウム	120g
マレイン酸カルビノキサミン	7.5g
リン酸ジヒドロコデイン	24g
塩酸アンブロキシソール	45g

きには、必要に応じて他の非ステロイド性抗炎症薬、消炎酵素薬類、気管支拡張薬、中枢神経興奮薬、鎮咳薬、去痰薬、他の抗ヒスタミン薬、他の抗アレルギー薬、抗コリン薬、ビタミン類、制酸薬、生薬などを配合することもできる。

【0017】

【発明の効果】本発明により鼻閉症状の除去・軽減に対し劇的な効果を有する感冒・鼻炎用組成物が得られたので、風邪の早期治療に有効な感冒薬として有用である。

【0018】

【実施例】以下、実施例および試験例により本発明をさらに詳細に説明する。

実施例1

下記の各成分および分量を秤量し均一に混合した後、常法に従い1錠200mg

法に従い1錠200mgの錠剤を得た。

られた混合粉末を直打法により1錠重量100mgになるように打錠し、錠剤を得た。

塩化リゾチーム 90 g (力価)
 乳糖 55 g
 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース 30.5 g
 ステアリン酸マグネシウム 18 g
 硬化ヒマシ油 10 g

【0021】実施例4

pH調整剤(リン酸緩衝液)を溶解した水溶液(pH=4.5)に、防腐剤、甘味剤および香料を加え完全に溶解した。その溶液にショ糖脂肪酸エステルを均一に分散した後、ナプロキセンおよびその他の薬剤を加え溶解させた後、精製水を加えて全量を1000mlにして液剤を得た。

ロキソプロフェンナトリウム 120 g
 リン酸ジヒドロコデイン 24 g
 塩酸エピナスチン 20 g
 d1-塩酸メチルエフェドリン 60 g
 塩酸アンブロキシソール 45 g
 無水カフェイン 75 g

(単位: mg)

ビタミンB₁硝酸塩 8 g
 ビタミンB₂ 4 g
 ショ糖脂肪酸エステル 15 g
 マンニトール 15 g
 ステビア 10 g
 アミノ安息香酸エチル 5 g
 オレンジフレーバー 0.8 g

【0022】試験例1 [配合剤の嗅覚強度に対する効果]

《試験方法》表1に示した各処方について嗅覚強度に対する効果を求めた。

【0023】

【表1】

成分	群	A群	B群	C群	D群	E群
ロキソプロフェンナトリウム		180	180	180	180	180
マレイン酸カルビノキサミン		7.5	/	/	/	/
マレイン酸クロルフェニラミン		/	24	/	/	/
フマル酸ケトチフェン		/	/	2	/	/
メキタジン		/	/	/	4	/
塩酸エピナスチン		/	/	/	/	20

成分	群	F群	G群	H群	I群	J群
ロキソプロフェンナトリウム		/	/	/	/	/
マレイン酸カルビノキサミン		7.5	/	/	/	/
マレイン酸クロルフェニラミン		/	24	/	/	/
フマル酸ケトチフェン		/	/	2	/	/
メキタジン		/	/	/	4	/
塩酸エピナスチン		/	/	/	/	20

成分	群	K群	L群
ロキソプロフェンナトリウム		180	/
マレイン酸カルビノキサミン		/	/
マレイン酸クロルフェニラミン		/	/
フマル酸ケトチフェン		/	/
メキタジン		/	/
塩酸エピナスチン		/	/

鼻閉(鼻づまり)症状を有する60名を、A～L群の1

2群に各5名ずつに分けた。各被験者に表1に示した処

方の試験薬剤を1日3回3日間服用し改善効果を比較した。判定方法は、20%メントール溶液を浸した紙を用いて、その揮発性芳香の嗅覚強度を測定することによって行った。なお、投与前の嗅覚強度を基準にその推移を3日後まで判定した。

【0024】判定基準は、3点：強く感じる、2点：感

じる、1点：わずかに感じる、0点：全く感じないの4段階とし、各群の平均点で比較した。

【0025】結果を表2に示した。

【0026】

【表2】

群	投薬前	1日後	2日後	3日後
A群	0.6	1.6	2.0	2.4
B群	0.6	1.4	2.0	2.4
C群	0.4	1.6	2.4	2.8
D群	0.6	1.6	2.2	2.6
E群	0.6	1.4	2.2	2.8
F群	0.8	1.2	1.2	1.4
G群	0.6	1.0	1.2	1.4
H群	0.8	1.0	1.4	1.6
I群	0.6	1.0	1.2	1.2
J群	0.4	0.8	1.0	1.2
K群	0.8	0.8	1.0	1.2
L群	0.6	0.6	0.8	0.8

嗅覚強度の程度は、A～E群の組み合わせ処方群の方がF～L群の対照群より優っており、本発明の配合薬に優

れた効果があることが証明された。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.⁷

A61P 29/00
31/00

識別記号

F I

A61P 29/00
31/00

テーム(参考)

Fターム(参考) 4C086 AA02 BC17 CB09 CB11 CB29
MA02 MA03 MA04 NA14 ZA34
ZA59 ZB11 ZB13 ZC13
4C206 AA02 DB21 MA02 MA03 MA04
NA14 ZA34 ZA59 ZB11 ZB13
ZC13